

2/TI,PN,PA,AX,PR,AB/1  
 DIALOG(R)File 351:(c) 2000 Derwent Info Ltd. All rts. reserv.

WPI Acc No: 1987-240051/

XRAM Acc No: C87-101515

Skin cosmetics for preventing ageing - comprise ascorbic acid deriv. and at least one vitamin-E (deriv.)

Patent Assignee: KANEBO LTD (KANE )

Patent Family:

Patent No	Kind	Date	Applicat No	Kind	Date	Week
JP 62164609	A	19870721	JP 865881	A	19860114	198734 B
JP 94078223	B2	19941005	JP 865881	A	19860114	199438
JP 62164609	A	19870721	198734 B			
JP 94078223	B2	19941005	199438			

Priority Applications (No Type Date): JP 865881 A 19860114

Abstract (Basic): JP 62164609 A

Cosmetics comprises ascorbic acid deriv. of formula (I) (where at least one of X1-X4 are pivaloyl gp and the rest is H); and one or more of vitamin E, vitamin E acetate, vitamin E nicotinate and vitamin E orotate.

USE/ADVANTAGE - Cosmetics obt'd., inhibit the ageing of skin.

O/O

?bye.

12sep00 21:54:23 User241582 Session D168.2

\$8.83 0:401 DialUnits File351

\$8.36 2 Type(s) in Format 49 (UDF)

\$8.36 2 Types

\$17.19 Estimated cost File351

\$0.83 MARKNET

\$18.02 Estimated cost this search

\$18.17 Estimated total session cost 0.583 DialUnits

### Status: Signed Off. (2 minutes)

## ⑫ 公開特許公報(A) 昭62-164609

⑤ Int. Cl.<sup>4</sup>

識別記号

庁内整理番号

④ 公開 昭和62年(1987)7月21日

A 61 K 7/00

7306-4C

審査請求 未請求 発明の数 1 (全6頁)

⑬ 発明の名称 皮膚化粧料

⑭ 特 願 昭61-5881

⑮ 出 願 昭61(1986)1月14日

⑯ 発 明 者 元 井 利 幸 小田原市高田大字北ノ前139番地の6

⑰ 出 願 人 鐘 紡 株 式 会 社 東京都墨田区墨田5丁目17番4号

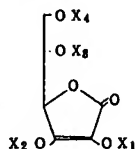
## 明 細 書

## 1. 発明の名称

皮膚化粧料

## 2. 特許請求の範囲

## (1) 下記一般式



(式中、X<sub>1</sub>, X<sub>2</sub>, X<sub>3</sub>, X<sub>4</sub>のうち少なくとも1つはピバロイル基を示し、残基は水素原子を示す。)

で表わされるアスコルビン酸誘導体の少なくとも一つと、ビタミンE、ビタミンEアセテート、ビタミンEニコチネート、ビタミンEオロテートからなる群から選択された化合物の少なくとも一つとを配合してなる皮膚化粧料。

## 3. 発明の詳細な説明

## (産業上の利用分野)

本発明は、後記特定のアスコルビン酸誘導体とビタミンE系化合物を含有する皮膚化粧料に関し更に詳しくは、人体に好ましくない副作用や皮膚刺激を有さず、長期保存しても安定で、しかも優れた肌荒れ防止効果、皮膚の老化防止効果および優れた美白効果を同時に発現、付与し得る皮膚化粧料に関する。

## (従来の技術)

老化した皮膚は柔軟性、弾力性を失い、皮膚のシワが増大し、乾燥して滑らかさのない荒れ肌で、角質細胞剝離現象が認められる。

最近、皮膚老化防止に関する化粧料が僅かに提案されているが、十分な効果を有するものが見えない。

一方、日焼けした肌を健康な肌色に回復するには、増加形成しているメラニン色素の褪色漂白やメラニン生成過程でのチロシナーゼ活性の阻害等が必要であるとされている。

これらの原理を応用した美白化粧料の活性物質

として、いくつかのアスコルビン酸誘導体が研究され、アスコルビン酸の3-モノ直鎖脂肪酸エステル、2, 6-ジ直鎖脂肪酸エステル等が提案されている(特公昭45-15391号、特公昭45-23634号)。しかしながら、化粧品に応用した場合、経日安定性に問題があったり、変色、変臭の原因となったり、また優れた美白効果が得られないという欠点がある。

このように、皮膚老化防止効果と美白効果を発現、付与し得る優れた皮膚化粧品は未だ見られない。

(発明が解決しようとする問題点)

本発明の目的は、長期保存しても安定で、変色、変臭、活性低下等を起こすことなく、使用時には皮膚刺激なく良好な感触を与えながら身体を美化し、魅力を増し、皮膚をすこやかに保ち、皮膚老化防止効果と美白効果とを同時に発現、付与し得る優れた皮膚化粧品を提供することにある。

(問題点を解決するための手段)

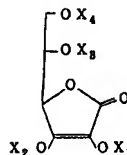
上述の目的は、

1-O-ビパロイルアスコルビン酸、3-O-ビパロイルアスコルビン酸、5-O-ビパロイルアスコルビン酸、6-O-ビパロイルアスコルビン酸、2, 6-ジ-O-ビパロイルアスコルビン酸、3, 6-ジ-O-ビパロイルアスコルビン酸、5, 6-ジ-O-ビパロイルアスコルビン酸、2, 3-ジ-O-ビパロイルアスコルビン酸、2, 5, 6-トリ-O-ビパロイルアスコルビン酸、3, 5, 6-トリ-O-ビパロイルアスコルビン酸、2, 3, 5, 6-テトラ-O-ビパロイルアスコルビン酸等である。

本発明において、前記のビパロイルアスコルビン酸は、各々単独でもしくはその2つ以上の混合物として皮膚化粧品基剤に配合される。その配合量は、皮膚化粧品の形態(種類)によって異なるけれども、総合的な配合量は、当該化粧品の処方成分全量を基準として(以下同様)、通常0.05~10重量%、好ましくは0.5~3重量%の範囲内である。

本発明に使用する前記のビタミンE系化合物と

下記一般式



(式中、 $X_1$ ,  $X_2$ ,  $X_8$ ,  $X_4$ のうち少なくとも1つはビパロイル基を示し、残基は水素原子を示す。)

で表わされるアスコルビン酸誘導体(以下、便宜上ビパロイルアスコルビン酸という)の少なくとも一つと、ビタミンE、ビタミンEアセテート、ビタミンEニコチネート、ビタミンEオロテート(以下便宜上、~~ビタミンE~~からなる群から選択された化合物の少なくとも一つとを配合してなる皮膚化粧品によって達成される。

本発明に使用する前記のビパロイルアスコルビン酸は、例えばアスコルビン酸とビパリン酸、またはアスコルビン酸とビパロイルクロリドとを反応させることによって得られる。

前記のビパロイルアスコルビン酸としては、2

しては、ビタミンE、ビタミンEアセテート、ビタミンEニコチネート、ビタミンEオロテートである。ビタミンEとは、 $\alpha$ -トコフェロール、 $\beta$ -トコフェロール、 $\gamma$ -トコフェロール、 $\delta$ -トコフェロールまたはこれらの混合物を指す。これらのビタミンE系化合物は、各々単独でもしくはその2つ以上の混合物として皮膚化粧品基剤に配合される。その総合的な配合量は、通常0.01~5重量%、好ましくは0.1~2重量%の範囲内である。また、ビパロイルアスコルビン酸(A)とビタミンE系化合物(B)との配合割合は、(A):(B)=3:1~1:2の範囲が好ましい。

本発明の皮膚化粧品の剤型は、特に限定されるものでなく、クリーム状、乳液状、ローション状、パウダー状等々の通常の化粧品の剤型を適用することが出来る。

本発明の化粧料は、他の成分として、乳化剤、油性物質、保湿剤、香料、防腐剤、着色料、皮膚栄養剤などを本発明の目的を達成する範囲内で適宜配合し得る。

## (発明の効果)

本発明の皮膚化粧品は、皮膚機能を亢進し、肌のしわを防止し、肌理(きめ)こまかなかつはりのある皮膚にすると共に、優れた美白効果等を発現し得る。

## (作用)

本発明におけるビパロイルアスコルビン酸は、適度な親水性と親油性を有し化粧料の系中での安定性、化粧料基材との相溶性、乳化性、人体に対する安全性が高く良好であるので、皮膚化粧料の処方設計が容易となり、そして経日安定性が良好で、皮膚刺激なくフィーリングの良い良好な感触を与える化粧料を提供することができる。

本発明の皮膚化粧料を皮膚に塗布すると前記ビパロイルアスコルビン酸は速やかに皮膚中に溶解、拡散して容易に皮内に浸透して、皮膚組織の活性および代謝を促進する。そして、同様に皮内に浸透したビタミンE系化合物との相補的、相乗的な作用により、前記の顕著な効果を奏し得る。

## (実施例)

## (2) 官能効果のパネルテスト

50名の中年(30~50才)女子パネルーの顔面に試料を1日2回、2ヶ月間連続塗布し、パネルー本人が試験開始前および終了後の皮膚の状態を、「しわ伸ばし効果」、「はりに対する効果」、「きめに対する効果」につきそれぞれ評価した。

## (3) 美白効果のパネルテスト

日焼けに悩む被験者(女子)20名のパネルーに試料を毎日朝・夕一回2ヶ月塗布し、「有効」、「やや有効」または「無効」のいずれかをパネルー本人が判定した。

## (4) 皮膚色明度回復試験

被試験者20名の背部皮膚にUV-B領域の紫外線を最小红斑量の2倍量照射し、1週間後、その照射部に試料塗布部位と非塗布部位とを設定して各々の皮膚の基準明度( $V_0$ 値、 $V_0'$ 値)を測定した。引続いて塗布部位には試料を1日1回ずつ8ヶ月間連続塗布し、18週間後の塗布部位及び非塗布部位の皮膚の明度( $V_n$ …値、 $V_n'$ …値)を測定して、第1表の判定基準により、皮膚色の

以下、実施例について説明する。

なお、実施例に示す%とは重量%を意味する。

実施例に記載の角質層のターンオーバー速度測定方法、官能効果のパネルテスト、美白効果のパネルテスト、皮膚明度回復試験法は下記の通りである。

## (1) 角質層のターンオーバー速度測定方法

蛍光色素のダンシルクロライドを白色ワセリン中に5重量%配合した軟膏を作り、被験者の前腕部の皮膚に24時間閉塞貼布し、角質層にダンシルクロライドを浸透結合させる。その後同じ部位に1日2回(朝・夕)被験試料を塗布し、毎日ダンシルクロライドの蛍光をしらべ、その蛍光が消滅するまでの日数を皮膚角質層のターンオーバー速度とした。なお、通常の皮膚角質層のターンオーバー速度は14~18日であるが、老化した皮膚においては18日前後にのびる。それに対して老化防止効果が現われると12日前後にまで短縮される。今回は被験者5名により行ない、平均値を算出した。

回復評価を実施した。

尚、皮膚の明度(V値)は高分光色彩計で測定して得られたマンセル値より算出した。また、評価は被試験者20名の18週間後の評価点の平均値で示した。

第 1 表

評価点	判定基準
5	18週間後の皮膚明度の回復が下式を満足する試料。 $\Delta V - \Delta V' \geq 0.15$ $\Delta V \cdots \text{塗布部位の回復値}$ $(V_n - V_0)$ $\Delta V' \cdots \text{非塗布部位の回復値}$ $(V_n' - V_0')$
4	$0.15 > \Delta V - \Delta V' \geq 0.1$
3	$0.1 > \Delta V - \Delta V' \geq 0.05$
2	$0.05 > \Delta V - \Delta V' \geq 0$
1	$0 > \Delta V - \Delta V'$

実施例 1 ~ 4、比較例 1 ~ 4

(二層型ローション)

下記の組成に於いて第 2, 8 表に示す通りにアスコルビン酸の誘導体とビタミン E 系化合物の種類及び配合量を変えて、実施例、比較例である二層型ローションを調製して諸試験を実施した。その結果を第 2, 8 表に示した。

## 組 成

原 料 成 分		配合量 (wt%)
(A)	○ アスコルビン酸誘導体	第 2, 8 表に記載
	○ ビタミン E 系化合物	"
(B)	○ オリーブ油	15.0
	○ ミリスチン酸イソプロピル	5.0
	○ ポリオキシエチレンニルフェニールエーテル	0.5
(C)	○ グリセリン	5.0
	○ メチルパラベン	0.1
	○ エタノール	7.0
	○ 精製水	総量を 100.0 とする数量

第 2 表

項 目	アスコルビン酸 誘 導 体 (配合量)wt%	ビタミン E 系化合物 (配合量)wt%	官 能 効 果 (有効な結果を得た人数)			角質層の ターン オーバー 速 度 (日数)	皮膚色明度 回復試験	美白効果 (有効な 結果を得 た人数)
			し わ 伸ばし	は り	き め			
比較例 1	6-O-ステアロイル アスコルビン酸 (1.5)	—	1	1	1	15.5	1.80	2
" 2	2, 6-ジ-0- パルミトイル アスコルビン酸 (1.5)	—	2	3	2	15.3	1.85	3
" 3	—	ビタミン E アセテート (0.5)	0	0	0	15.4	1.60	0
" 4	—	ビタミン E オロテート (0.5)	4	3	5	15.0	1.50	0
実施例 1	6-O-ビバロイル アスコルビン酸 (1.5)	α-トコ フェロール (0.5)	45	45	43	13.2	3.90	18

第 8 表

項 目	アスコルビン酸 誘 導 体 (配合量) wt%	ビタミンE系化合物 (配合量) wt%	官 能 効 果 (有効な結果を得た人数)			角質層のターン オーバー速度 (日数)	皮膚色明度 回復試験	美白効果 (有効な結果 を得た人数)
			し わ 仲はし	は り	き め			
実 施 例 2	2, 6-ジ-0- ビバロイル アスコルビン酸 (1.5)	ビタミンEアセテート (0.5)	4 6	4 7	4 6	1 2.8	4.0 5	1 9
" 3	2, 5, 6-トリ- 0-ビバロイル アスコルビン酸 (1.5)	ビタミンEニコチネート (0.5)	4 3	4 4	4 4	1 3.0	3.9 7	1 8
" 4	2, 3, 5, 6- テトラ-0- ビバロイル アスコルビン酸 (1.5)	ビタミンEオロテート (0.5)	4 4	4 5	4 5	1 3.3	2.9 3	1 8

実施例5～7、比較例5～6

(スキนครリーム)

実施例1と同様に、下記の組成に於いて種々の  
実施例、比較例のスキนครリームを調製して諸試  
験を実施した。その結果を第4表に示した。

組 成

原 料 成 分		配合量 (wt%)
(A)	。アスコルビン酸誘導体	第4表に記載
	。ビタミンE系化合物	"
(B)	。スクアラン	1 0. 0
	。オリーブ油	1 0. 0
	。固型パラフィン	5. 0
	。セタノール	4. 0
	。ソルビタンモノステアレート	1. 0
	。ポリオキシエチレン ソルビタン モノステアレート	1. 2
(C)	。グリセリン	5. 0
	。メチルパラベン	0. 1
	。精製水	残量

第 4 表

項 目	アスコルビン酸 誘 導 体 (配合量) wt%	ビタミンE系化合物 (配合量) wt%	官 能 効 果 (有効な結果を得た人数)			角質層のターン オーバー速度 (日数)	皮膚色明度 回復試験	美白効果 (有効な結果 を得た人数)
			し わ 伸ばし	は り	き め			
比較例 5	6-0-ステアロイル アスコルビン酸 (0.5)	—	1	1	1	15.5	1.84	2
" 6	—	α-トコフェロール (1.0)	8	2	4	15.2	1.55	0
実施例 5	2, 6-ジ-0-ビバ ロイルアスコルビン酸 (0.5)	ビタミンEニコチネート (1.0)	47	48	47	12.6	4.10	19
" 6	同 上 (0.5)	ビタミンEオロテート (1.0)	48	49	48	12.5	4.15	19
" 7	2, 5, 6-トリ-0- ビバロイルアスコル ビン酸 (0.25)  2, 3, 5, 6-テトラ- 0-ビバロイルアス コルビン酸 (0.25)	ビタミンEアセート (1.0)	42	48	42	13.4	4.02	18